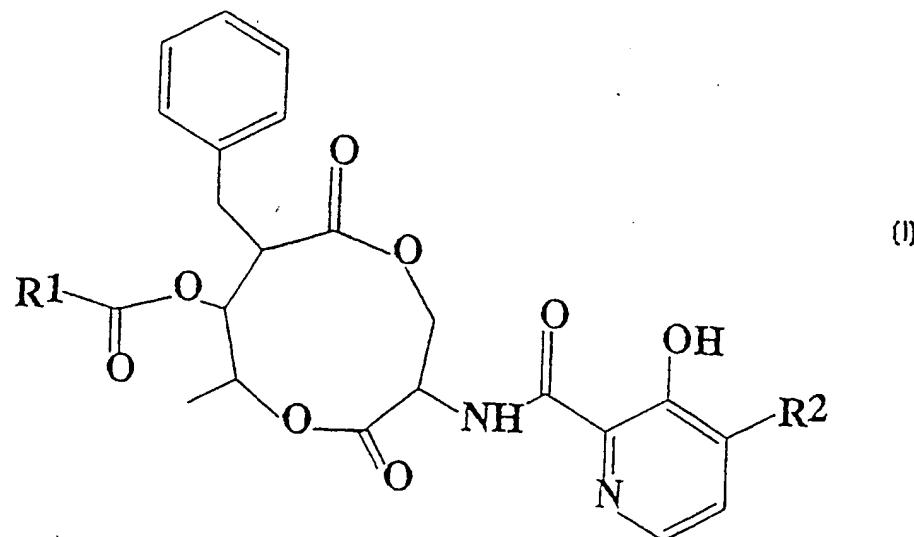


(51) 国際特許分類6 A01N 43/40	A1	(11) 国際公開番号 WO99/11127
		(43) 国際公開日 1999年3月11日(11.03.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/03876		
(22) 国際出願日 1998年8月31日(31.08.98)		
(30) 優先権データ 特願平9/233658 1997年8月29日(29.08.97)	JP	阪中 治(SAKANAKA, Osamu)[JP/JP] 三友宏一(MITOMO, Koichi)[JP/JP] 〒250-0852 神奈川県小田原市柏山788 明治製薬株式会社 薬品技術研究所内 Kanagawa, (JP) 谷口 誠(TANIGUCHI, Makoto)[JP/JP] 〒596-0827 大阪府岸和田市上松町1201-3 Osaka, (JP)
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 明治製薬株式会社 (MEIJI SEIKA KAISHA, LTD.)[JP/JP] 〒104-8002 東京都中央区京橋二丁目4番16号 Tokyo, (JP)		(74) 代理人 弁理士 佐藤…雄, 外(SATO, Kazuo et al.) 〒100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo, (JP)
(72) 発明者 : および		(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ニーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 歐州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 寺岡 豪(TERAOKA, Takeshi)[JP/JP] 葛原喜久子(KUZUHARA, Kikuko)[JP/JP] 御子柴春樹(MIKOSHIBA, Haruki)[JP/JP] 松本邦臣(MATSUMOTO, Kuniomi)[JP/JP] 〒222-8567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製薬株式会社 薬品総合研究所内 Kanagawa, (JP) 板沼勝春(IINUMA, Katsuharu)[JP/JP] 二村幸文(FUTAMURA, Takafumi)[JP/JP] 安武哲也(YASUTAKE, Tetsuya)[JP/JP]		添付公開書類 国際調査報告書

(54) Title: RICE BLAST CONTROL AGENT AND WHEAT SCAB CONTROL AGENT

(54) 発明の名称 イネいもち病防除剤およびコムギ赤さび病防除剤

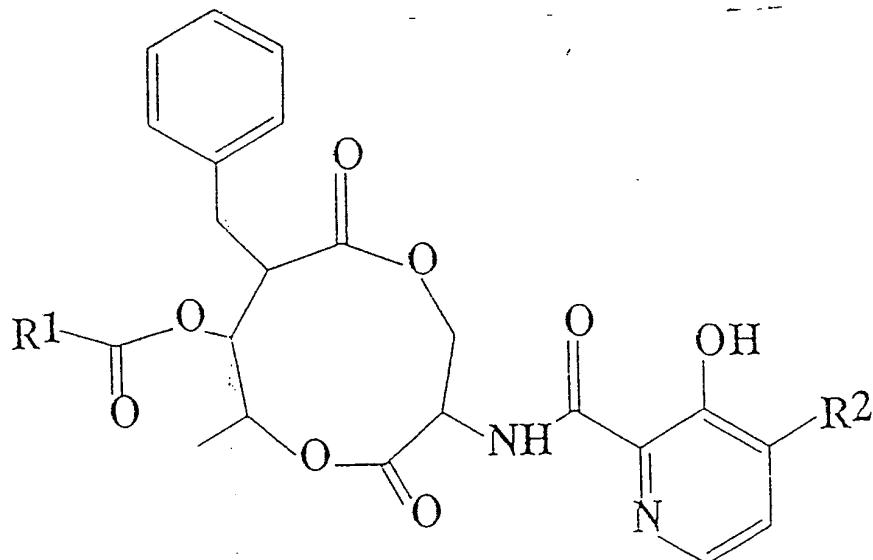


BEST AVAILABLE COPY

## (57) Abstract

Rice blast and wheat scab control agents and a method of preventing and exterminating these diseases. The rice blast control agent or the wheat scab control agent contains a compound represented by formula (I) in which R<sup>1</sup> represents alkyl or alkenyl and R<sup>2</sup> represents

イネいもち病およびコムギ赤さび病の防除剤およびそれらを予防駆除する方法が開示されている。本発明によるイネいもち病防除剤またはコムギ赤さび病防除剤は、下記の式(I)で表される化合物を含んでなるものである。下記の式(I)の化合物は、イネいもち病およびコムギ赤さび病に対して極めて強い病害予防駆除効果を有し、かつ病害駆除の対象である植物に対して薬害を及ぼさない特質を有する。



BEST AVAILABLE COPY

(I)

[式中、R<sup>1</sup>はアルキル基またはアルケニル基を表し、R<sup>2</sup>は水素原子またはメトキシ基を表す]

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア
AM	アルメニア	FR	フランス	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AT	オーストリア	GA	ガボン	LS	レソト	SL	シエラ・レオネ
AU	オーストラリア	GB	英国	LT	リトアニア	SN	セネガル
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SZ	スウェーデン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴー
BE	ベルギー	GM	カンボジア	MD	モルドavia	TJ	タジキスタン
BF	ブルガリア・ファソ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサオ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TR	トルコ
BJ	ベナン	CR	ギリシャ	共和国		TT	トリニダッド・トバゴ
BR	ブラジル	HR	クロアチア	ML	マリ	UA	ウクライナ
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	UG	ウガンダ
CA	カナダ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	US	米国
CF	中央アフリカ	IE	アイルランド	MW	マラウイ	UZ	ウズベキスタン
CG	コンゴー	IL	イスラエル	MX	メキシコ	VN	ヴィニトナム
CH	スイス	IN	インド	NE	ニジニール	YU	ユーゴースラビア
CI	コートジボアール	IS	アイスランド	NL	オランダ	ZW	ジンバブエ
CM	カメルーン	IT	イタリア	NO	ノールウェー		
CN	中国	JP	日本	NZ	ニュージーランド		
CU	キューバ	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CY	キプロス	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
CZ	チエコ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DE	ドイツ	KR	韓国	RU	ロシア		
DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	SD	スードン		
EE	エストニア	LC	セントルシア	SE	スウェーデン		

## 明細書

## イネいもち病防除剤およびコムギ赤さび病防除剤

## [発明の背景]

発明の分野

本発明は、イネいもち病およびコムギ赤さび病の防除剤およびそれらを予防駆除するための方法に関する。

背景技術

農園芸植物の疾病は農園芸植物の収穫に大きな影響を及ぼすことから、農園芸植物の病害を予防駆除することは農業および社会経済上極めて重要な課題である。特に主要な穀物であるイネおよびコムギにおいてそれぞれ重要とされる、いもち病および赤さび病の予防駆除は、古くからその解決が望まれている課題である。

例えば、イネいもち病に対する薬剤としては、カスガマイシン等の抗生物質、有機リン系化合物等のリン脂質生合成阻害剤、あるいはトリシクラゾール、フサライド等のメラニン色素生合成阻害剤等、種々の薬剤が開発され実用に供されている。また、コムギ赤さび病についても、例えばトリアジメホン等のトリアゾール系のEBI剤、メプロニル等の酸アミド系剤、無機硫黄剤等、種々の薬剤が一般的に用いられている。

しかし、これら病害を予防駆除する薬剤の提供が依然として望まれており、さらに環境および人畜への安全性、経済性の点でさらに優れた薬剤の開発が望まれているといえる。

一方で、特開平7-233165号、J. Antibiotics 49:639-643(1996)、およびJ. Antibiotics 50:551-555(1997)は、後記する式(I)で表される化合物の一部が開示かれている。

例えば、特開平7-233165号には、後記する式（I）において、 $R^1$ がイソプロピル基であり $R^2$ がメトキシ基である化合物（以下、UK-2Aと呼ぶことがある）、 $R^1$ が(Z)-2-ブテニル基であり $R^2$ がメトキシ基である化合物（以下、UK-2Bと呼ぶことがある）、 $R^1$ がイソブチル基であり $R^2$ がメトキシ基である化合物（以下、UK-2Cと呼ぶことがある）、 $R^1$ がsec-ブチル基であり $R^2$ がメトキシ基である化合物（以下、UK-2Dと呼ぶことがある）が、実施例化合物として開示されている。

また、J. Antibiotics 50:551-555(1997)には、後記する式（I）における、 $R^1$ がイソプロピル基であり $R^2$ が水素である化合物（以下、UK-3Aと呼ぶことがある）が、上記UK-2A、UK-2B、UK-2C、およびUK-2Dと同様な作用特性を有することが示されており、その製法についても記載されている。

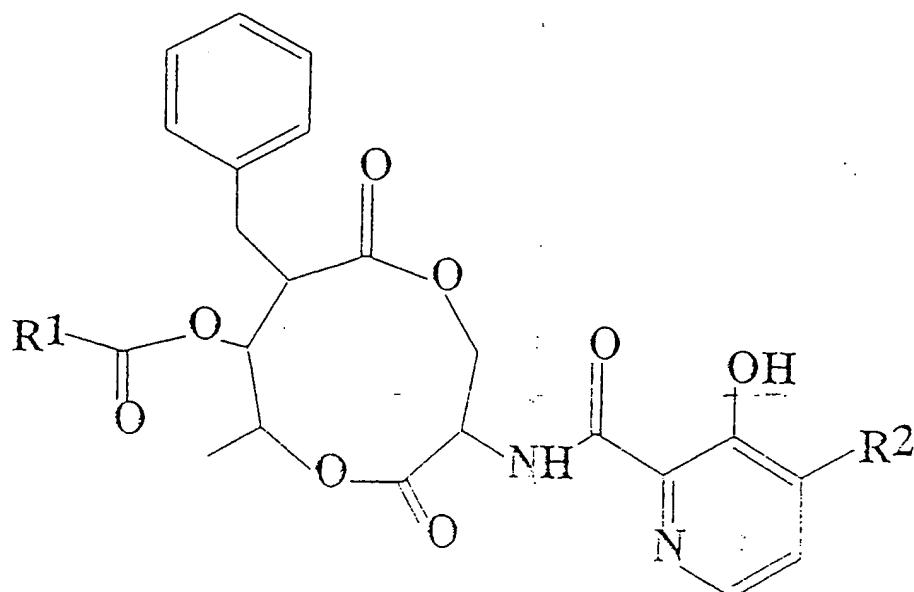
また、上記文献においてこれら化合物は、その抗真菌活性から、医療用抗真菌剤、農園芸用防カビ剤および工業用防カビ剤の有効成分として有用であることが記載されている。

### 〔発明の概要〕

本発明者等は、今般、ある種の公知化合物がイネいもち病およびコムギ赤さび病に対して極めて強い病害予防駆除効果を有し、かつ病害駆除の対象である植物に対して薬害を及ぼさない特質を有するとの知見を得た。本発明は、かかる知見によるものである。

よって、本発明は、イネいもち病およびコムギ赤さび病の防除剤およびそれらを予防駆除する方法の提供をその目的としている。

そして、本発明によるイネいもち病防除剤またはコムギ赤さび病防除剤は、下記の式（I）で表される化合物を含んでなるものである：



(I)

[式中、

R<sup>1</sup>は直鎖若しくは分岐鎖状である飽和脂肪族炭化水素基、または直鎖若しくは分岐鎖状である不飽和脂肪族炭化水素基を表し、

R<sup>2</sup>は水素原子またはメトキシ基を表す]

また、本発明によるイネいもち病防除法またはコムギ赤さび病防除法は、前記式(I)で表される化合物を、イネまたはコムギの植物体自体、その種子、それが生育しているまたは生育を予定された圃場、その生育に利用される器具に施用する工程を含んでなるものである。

#### [発明の具体的説明]

##### 微生物の寄託

式(I)の化合物を产生する微生物である *Streptoverticillium* sp. SAM2084 菌株は、F E R M B P - 6 4 4 6 のもと、工業技術院生命工学工業技術研究所（日本国茨城県つくば市東1丁目1番3号）に寄託されている。この寄託の寄託者はサントリー株式会社（日本国大阪市北区堂島浜2丁目1番40号）である。

また、この寄託の原寄託は平成6年2月17日付け、F E R M - P - 1 4 1 5 4 であり、ブタペスト条約に基づく寄託への移管請求の受領日は平成10年8月3日である。

### 式(I)の化合物

本発明は、式(I)で表される化合物が、イネいもち病およびコムギ赤さび病に対して極めて強い病害予防駆除効果を有し、かつ病害駆除の対象である植物に対して薬害を及ぼさない特質を有することに基礎をおく。

前記したように式(I)で表される化合物は公知化合物であり、さらにこの化合物が抗真菌活性を有し、医療用抗真菌剤、農園芸用防カビ剤および工業用防カビ剤の有効成分として有用であることも記載されている。式(I)の化合物は種々の真菌に対する抗菌活性を有するものであるが、イネいもち病およびコムギ赤さび病に対してとりわけ顕著な予防駆除活性を示すことは当業者の予想を超える意外な事実であるといえる。

前記式(I)において、R<sup>1</sup>が表す直鎖または分岐鎖状の飽和脂肪族炭化水素基は、炭素数が1～18であるのが好ましく、より好ましくは炭素数1～6であり、特に好ましい炭素数は3または4である。その例としては、アルキル基が挙げられ、炭素数が1～18のアルキル基が好ましく、より好ましくは炭素数1～6のアルキル基であり、特に好ましい炭素数は3または4のアルキル基である。その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、ウンデシル基、トリデシル基、ペンタデシル基、ヘプタデシル基等があげられる。

また、前記式(I)において、R<sup>1</sup>が表す直鎖または分岐鎖状の不飽和脂肪族炭化水素基は、炭素数が2～18であり、少なくとも一つの二重結合を有するも

のが好ましく、より好ましくは炭素数2～6であり、特に好ましい炭素数は3または4である。その例としては、アルケニル基が挙げられ、炭素数が1～18のアルケニル基が好ましく、より好ましくは炭素数2～6のアルケニル基であり、特に好ましい炭素数は3または4のアルケニル基である。その具体例としては、ビニル基、イソプロペニル基、(Z)-1-プロペニル基、(E)-1-プロペニル基、(Z)-2-ブテニル基、(E)-2-ブテニル基、(Z)-8-ヘプタデセニル基、(E)-8-ヘプタデセニル基等があげられ、特にイソプロピル基、(Z)-2-ブテニル基、イソブチル基、またはsec-ブチル基が好ましい。

また、前記式(I)において、R<sup>2</sup>は水素原子またはメトキシ基である。

本発明の好ましい態様によれば、好ましい式(I)の化合物としては、R<sup>1</sup>がイソプロピル基、(Z)-2-ブテニル基、イソブチル基、またはsec-ブチル基であり、R<sup>2</sup>が水素原子またはメトキシ基である化合物が挙げられる。さらに、好ましい具体的な化合物としては、上記したUK-2A (R<sup>1</sup>がイソプロピル基であり、R<sup>2</sup>がメトキシ基である化合物)、UK-2B (R<sup>1</sup>が(Z)-2-ブテニル基であり、R<sup>2</sup>がメトキシ基である化合物)、UK-2C (R<sup>1</sup>がイソブチル基であり、R<sup>2</sup>がメトキシ基である化合物)、UK-2D (R<sup>1</sup>がsec-ブチル基であり、R<sup>2</sup>がメトキシ基である化合物)、およびUK-3A (R<sup>1</sup>がイソプロピル基であり、R<sup>2</sup>が水素である化合物)が挙げられる。

### 式(I)の化合物の生産

式(I)の化合物は、ストレプトバーティシリウム (*Streptoverticillium*) に属する微生物から得ることができる。

ストレプトバーティシリウムに属する微生物は、土壤等の微生物分離源から常法に従って放線菌を分離し、次にこれらの菌株から式(I)の化合物を产生する菌株を選択することにより得ることができる。

式(I)の化合物産生菌の一例としては、ストレプトバーティシリウム sp. SAM2084 菌株と命名された、平成6年2月17日に受託番号F E R M P-14154として工業技術院生命工学工業技術研究所に寄託した放線菌を挙げることができる。この微生物は、放線菌の保存のための常法に従って保存することができる。この微生物SAM2084菌株は次のような菌学的性質を有する。

(a) 形態的性状

栄養菌糸は長く伸長し、よく分岐していて、通常の条件下では分断されない。気菌糸はスター・チ寒天、グリセロール・アスパラギン寒天、イースト・麦芽寒天で豊富に着生し、胞子形成も良好である。気菌糸の分岐は典型的な車軸分岐である。分岐枝の先端はトックリの様な形態を呈し、10~20本の直線状の胞子連鎖を着生する。電子顕微鏡による観察では、胞子は円筒型、0.5~0.6×1.5~2.0 μmの大きさで、表面は平滑、通常10~20個程度連鎖する。胞子囊、運動性胞子および菌核は観察されない。

(b) 各種培地上の生育状態

各種寒天培地上の生育状態は、下記の第1表に示される通りである。表中、色の記載の括弧書に示す標準は、コンテナー・コーポレーション・オブ・アメリカ(Container Corporation of America)社製の「カラー・ハーモニー・マニュアル(Color Harmony Manual)」に記載されているものを用いた。観察は28°Cで14~21日培養した後に行った。

第 1 表

## 各種培地上の生育状態

培地	発育／裏面の色	気菌糸の性状／色	可溶性色素
ショーカロース硝酸塩寒天	微弱／なし	なし	なし
グルコース・アスパラギン寒天	良好／なし	なし	なし
リセロール・アスパラギン寒天	良好／黒褐色	豊富 繊毛状 ／淡黄灰色 (1 1/2ec)	淡褐色
スターチ寒天	良好／淡褐色	豊富 繊毛様 ／淡黄灰色 (1 1/2ec)	なし
オートミル寒天	普通／淡褐色	貧弱 ／淡灰色 (1dc)	なし
イースト・麦芽寒天	良好／黒褐色	豊富 繊毛様 ／灰緑色 (1 1/2ge)	黒褐色
チロシン寒天	微弱／なし	なし	なし
栄養寒天	普通／なし	なし	なし
リコ酸カルシウム寒天	微弱／なし	なし	なし
ベネット寒天	良好／淡褐色	豊富 繊毛様 ／灰緑色 (1 1/2ge)	淡褐色

## (c) 生理的性質

(1) 生育温度範囲：イースト・スター・チ寒天において $15\sim41^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で生育し、 $30^{\circ}\text{C}$ 付近で良好に生育する。

(2) ゼラチンの液化：陽性

(3) スター・チの加水分解：陽性

(4) 硝酸塩の還元：陽性

(5) 脱脂乳のペプトン化：陽性  
脱脂乳の凝固：陰性

(6) 耐塩性：1. 5% NaCl 含有培地では生育するが、NaCl が 3% 以上では強く生育阻害を受ける。

(7) メラニン様色素の生成：陰性

## (d) 炭素源の利用性 (ISP-9 培地使用)

(1) 利用する炭素源：D-グルコース、D-フルクトース、グリセロール、キシロース、D-マンニトール、myo-イノシトール、シュクロース、L-アラビノース

(2) 利用しない炭素源：L-ラムノース、ラフィノース

## (e) 菌体分析

ベッカー(Becker)らの方法(*Appl. Microbiol.* 13:236, 1965)により分析した結果、全菌体加水分解物中のジアミノピメリン酸は LL型であった。

## (f) 菌学的性質

以上の性状から、SAM 2084 菌株は放線菌の中でストレプトバーティシリウム属に所属し、気菌糸色調は「Yellow to Green」シリーズ、気菌糸の分岐は車軸型で胞子連鎖は直線状、胞子表面は平滑状、生育裏面の色調は淡褐色～黒褐色で、褐色系の可溶性色素を生産する菌株と要約される。

このような菌学的性質を持つ菌株を、ストレプトバーティシリウム属の種の記

載と比較すると、ストレプトバーティシリウム・モロオカエンス (*Streptoverticillium morookaense*) に近縁と考えられる。しかし、生理的性質で相違する点も幾つか存在しており、本菌株をストレプトバーティシリウム・エス・ピー・SAM2084菌株(*Streptoverticillium sp. SAM2084*)と呼称する。

式(I)の化合物は、前述のストレプトバーティシリウムに属する生産菌を培養することにより生産することができる。例えば、ストレプトバーティシリウム・エス・ピー・SAM2084菌株を培養して式(I)の化合物を生産蓄積させて、その培養液および/または培養菌体から通常の精製手段を用いて精製することにより生産することができる。

通常の培養では、式(I)の化合物は、R<sup>1</sup>に種々の炭化水素基が導入された類縁体の混合物として產生される。従って、様々な式(I)の化合物を生産するためには、培養培地に所望の脂肪族炭化水素基R<sup>1</sup>に対応する脂肪酸又はそのナトリウム塩、カリウム塩、アンモニウム塩等の可溶性塩を添加することが好ましい。例えば、上記の物質を好ましくは1~100 ppm、更に好ましくは1~10 ppm添加することにより、R<sup>1</sup>が所望の脂肪族炭化水素基である式(I)の化合物を得ることができる。

式(I)の化合物を製造する際、前記放線菌の培養に使用される培地は、液状でも固体でもよいが、通常は液体培地による振蕩培養または通気攪拌培養が有利である。

使用する培地は、生産菌が十分生育して式(I)の化合物を蓄積するものであれば、特に限定されない。具体的に、炭素源としては、生産菌が資化する糖類、例えばグルコース、ラクトース、グリセリン、デンプン、シュクロース、デキストリン、糖蜜等が用いられる。窒素源としては、例えばポリペプトン、カザミノ酸等の蛋白質加水分解物、肉エキス、酵母エキス、大豆粕、コーンスティーピリカ、アミノ酸類等の有機窒素源やアンモニウム塩や硝酸塩等の無機窒素源が用

いられる。

更に、任意の成分として、以下のものも培地に添加することができる。例えば、浸透圧調整、pH調整、微量成分の補給等のために、各種磷酸塩、硝酸マグネシウム、塩化ナトリウム、炭酸カルシウム等の無機塩類を添加することができる。また菌の生育を促進する目的で、各種ビタミン類、核酸関連化合物等をも添加しても良い。なお、培養期間中に、シリコン、ポリプロピレングリコール誘導体、大豆油等の消泡剤を添加することも可能である。

培養にあたっては、常法に従って、予め小規模で前培養を行って得られる培養物を用いて、本培養を行うことが望ましい。本培養の培養温度、培養期間、培養液のpH、通気量等の培養条件は、式(I)の化合物の蓄積が最大になるように、適切に選択し、調節することが必要である。

具体的には、通気条件は0.5vvm～2vvmが好ましく、より好ましくは0.5vvm～1vvm程度であり、培養温度は典型的には15℃～41℃、好ましくは20℃～37℃、より好ましくは25～30℃であり、培養期間は2～3日間であり、培養液のpHは、中性付近であることが好ましい。

式(I)の化合物は、上記培養において、培養液および菌体の両方に蓄積される。従って、培養液から抽出する場合には、酢酸エチル、クロロホルム、ジクロロメタン等の水不溶性の有機溶媒を用いて抽出することができる。また、培養菌体から抽出する場合には、濾過もしくは遠心分離等の手段で集菌した菌体を、アセトン等の細胞壁を破壊する作用を有する溶媒を用いて、直接抽出することができる。なお、培養菌体をガラスビーズ等を用いて破碎した場合には、培養液から抽出する場合と同様の手法により抽出することができる。

得られた粗抽出物から、式(I)の化合物を単離・精製するには、通常の精製法を用いることができる。例えば、溶媒転溶、順相および逆相カラムクロマトグラフィー、ゲル濾過クロマトグラフィー、結晶化等の精製手段を組み合わせるこ

とにより、単離・精製することができる。

本発明の式(I)の化合物は、R<sup>1</sup>に種々の炭化水素基が導入された類縁体の混合物として產生されるので、その類縁体の単離・精製には、順相および逆相の高速液体クロマトグラフィー(HPLC)を用いるのが特に有用である。

UK-2A～DおよびUK-3Aの単離・精製は具体的には、特開平7-233165号またはJ. Antibiotics 50:551-55(1997)の記載に準じて実施することができる。

#### イネいもち病およびコムギ赤さび病の防除剤およびそれらの防除法

本発明によるイネいもち病およびコムギ赤さび病の防除剤は、その活性成分として前記した式(I)の化合物を含んでなる。式(I)の化合物は、単離され、ある程度精製された化合物として防除剤に添加されるのが好ましいが、式(I)の化合物を產生する微生物またはその培養物の形態で防除剤にその活性成分として添加されてもよい。

本発明による防除剤は、担体を用い、更に必要に応じて適切な補助剤を配合して、適切な剤形とされて提供されることが好ましい。例えば油剤、乳剤、粉剤、水和剤、粒剤、懸濁剤等に製剤し、適宜希釈するなどして使用するのが好ましい。

好ましく用いられる担体としては、クレー、タルク、珪藻土、白土、炭酸カルシウム、無水珪酸、ベントナイト、硫酸ナトリウム、シリカゲル、有機酸塩類、糖類、澱粉、樹脂類、合成もしくは天然高分子等の固体粉末あるいは粒状担体、キシレン等の芳香族炭化水素類、ケロシン等の脂肪族炭化水素類、メチルエチルケトン、シクロヘキサン、イソホロン等のケトン類、ラクタム類、アニソール等のエーテル類、エタノール、プロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、水等の液体担体があげられる。

更に、防除剤の効果をより確実にするために、乳化剤、分散剤、湿润剤、結合

剤、沢剤等の補助剤を目的に応じて適宜選択し、組み合わせるなどして用いることが望ましい。そのような補助剤の例としては例えば非イオン性、イオン性の界面活性剤、カルボキシメチルセルロース、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ガム類、ステアリン酸塩類、ワックス、糊料等があげられる。

本発明による防除剤においては、式(I)の化合物を、通常、粉剤の場合には0.01~10重量%程度、好ましくは0.1~5重量%程度、水和剤の場合には1~90重量%程度、好ましくは5~75重量%程度、粒剤の場合には0.01~40重量%程度、好ましくは0.1~20重量%程度、液剤の場合には1~60重量%程度、好ましくは5~40重量%程度、懸濁剤の場合には1~80重量%程度、好ましくは5~50重量%程度含有させる。

本発明によるイネいもち病防除剤およびコムギ赤さび病防除剤は、単独で使用できることはもちろんであるが、プラストサイジンS、カスガマイシン、トリサイクラゾール、ピロキロン、イソプロチオラン、フサライド、プロベナゾール、メトキシアクリレート系、ベンズチアジアゾール系、シクロプロパン系、ピリミジン系、ジチオカーバメート系、カーバメート系、ベンズイミダゾール系、ベンズチアゾール系、トリアジン系、シアノ酢酸アミド系、イミダゾール系、ピロール系、ニコチノイド系、グアニジン系、ニトロメチレン系、シアノメチレン系、イソチアゾール系、アニライド系、キノリン系、有機塩素系、スルホン酸アミド系、ピレスロイド系、スルホニル尿素系、尿素系、有機リン系化合物等の殺菌剤、殺虫剤、除草剤、植物成長調節剤、あるいは肥料等と併用して、若しくは混合剤として使用することもできる。

本発明によるイネいもち病またはコムギ赤さび病の防除方法は、式(I)で表される化合物を、イネまたはコムギの植物体自体、その種子、それが生育しているまたは生育を予定された圃場、その生育に利用される器具に施用する工程を含んでなるものである。より具体的には、イネいもち病またはコムギ赤さび病の発

生が予想される場合に、あらかじめ式(I)の化合物を植物体の茎葉への散布するほか、植物体の経根、田面、水面、側条、土壤、種子、苗箱などに式(I)の化合物を施用する。あるいは、イネいもち病またはコムギ赤さび病菌に感染した結果、病害が発生、蔓延した後に、上記のように式(I)の化合物を使用することにより、病害を除きあるいは抑制することができる。

本発明による防除剤の適用量は、製剤の形態および施用する方法、目的、時期を考慮して適宜決定されるが、通常、有効成分である式(I)の化合物の量に換算して、イネいもち病防除の場合1ha当たり10～2000gの範囲で適用されるのが好ましく、より好ましくは50～1000gの範囲であり、コムギ赤さび病防除の場合1ha当たり5～1000gの範囲で適用されるのが好ましく、より好ましくは10～500gの範囲である。

#### [実 施 例]

以下に製剤例および試験例をあげて本発明を説明するが、本発明はこれに限定されるものではない。

実施例中で用いたUK-2A、UK-2B、UK-2C、UK-2D、およびUK-3Aは、特開平7-233165号またはJ. Antibiotics 50:551-555(1997)に記載の製造法にしたがって製造し、精製単離した。

##### 製剤例1：水和剤の調製

UK-2A 10重量部、ホワイトカーボン5重量部、ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル20重量部、およびクレー65重量部を均一に粉碎混合して、UK-2A 10%を含む水和剤を得た。この水和剤は、水等で1,000倍～100,000倍に希釈し、散布、浸漬する等の方法で使用することができる。

##### 製剤例2：粉剤の調製

UK-2A 0.3重量部、ステアリン酸マグネシウム0.5重量部、タルク59.2重量部、

およびクレー40重量部を均一に粉碎混合して、UK-2A0.3%を含む粉剤を得た。この粉剤はそのまま動力散粉機、パイプダスター、航空散布機等で散布したり、土壤処理または種子に粉衣するなどの方法で使用することができる。

#### 製剤例3：粒剤の調製

UK-2A 10重量部、クレー79重量部、リグニンスルホン酸カルシウム10重量部、およびポリビニルアルコール1重量部を均一に粉碎混合したのち加水練合し、造粒乾燥して、UK-2A10%を含む粒剤を得た。この粒剤は栽培圃場に散布して水面施用したり、育苗箱施用または土壤処理などの目的に使用することができる。

#### 製剤例4：液剤の調製（1）

UK-2A 2重量部、 $\delta$ -バレロラクタム10重量部、ポリオキシエチレンアルキル硫酸エステル10重量部、ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル5重量部、およびシクロヘキサン73重量部を均一に混合溶解して、UK-2A 2%を含有する液剤を得た。この液剤は適宜水で希釈し、散布、浸漬するなどの方法で使用することができる。

#### 製剤例5：液剤の調製（2）

UK-2A 3重量部、イソホロン77重量部、およびポリオキシアルキル硫酸エステル20重量部を均一に混合溶解して、UK-2A 3%を含有する液剤を得た。この液剤は適宜水で希釈し、散布、浸漬するなどの方法で使用することができる。

#### 実施例1：イネいもち病の防除

培養土を入れたプラスチック製ポットに8本ずつ育苗した4葉期のイネ苗（品種；十石）を供試植物とした。

製剤例4に記載された方法に準じて調製したUK-2A、UK-2B、UK-2C、UK-2D、またはUK-3Aをそれぞれ単独で含有する液剤、および市販の農園芸用殺菌剤であるラブサイドゾルを、それぞれ最終濃度が5.0 ppmになるように水で希釈して薬

液を調製した。

調製した薬液をスプレーガンを用いて、3ポット当たり10mlずつ供試植物の茎葉部に散布処理した。薬液を風乾した後、あらかじめオートミール寒天培地(オートミール5%、シュークロース1%、寒天1%)で28°C、8日間培養し、調製したイネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の分生胞子懸濁液( $1 \times 10^6$ 個/ml)を均一に噴霧して接種し、24°Cの湿室内に1夜静置した。その後夜間18°C、日中25°Cの人工気象室内に移して発病させ、接種7日後に接種葉に現れた病斑数を計数調査し、処理区のイネ苗一本当たりの平均病斑数を求め、下記の式によって防除率を算出した。また、薬液を散布せずに、上記と同様にイネいもち病菌の分生胞子懸濁液を接種し、発病させた無処理区のイネ苗一本当たりの平均病斑数から同様に防除率を算出した。

$$\text{防除率} = (1 - \text{処理区の平均病斑数} / \text{無処理区の平均病斑数}) \times 100$$

その結果は、下記第2表に示されるとおりであった。また、薬害は認められなかった。

第2表

イネいもち病防除効果試験結果

試料名	濃度(ppm)	防除率
無処理	—	0
UK-2A	5.0	100
UK-2B	5.0	100
UK-2C	5.0	100
UK-2D	5.0	100
UK-3A	5.0	100
ラブサイドゾル	5.0	57

### 実施例2：コムギ赤さび病の防除

培養土を入れたプラスチック製ポットに育苗した4葉期のコムギ苗（品種；農林61号）を供試植物とした。

製剤例4に記載された方法に準じて調製したUK-2A、UK-2B、UK-2C、UK-2D、またはUK-3Aをそれぞれ単独で含有する液剤、および市販の農園芸用殺菌剤であるバイレトン水和剤をそれぞれ最終濃度10 ppmになるように水で希釈して薬液を調製した。

調製した薬液をスプレーガンを用いて、3ポット当たり10mlずつ供試植物の茎葉部に散布処理した。薬液を風乾した後、あらかじめ赤さび病を発病させておいたコムギ葉より採集し調製した、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) の夏胞子懸濁液 ( $1 \times 10^6 / ml$ ) を均一に噴霧して接種し、21°Cの温室内に1夜静置した。その後夜間18°C、日中22°Cの人工気象室内に移して発病させ、接種14日後に接種葉に現れた発病面積を調査し、下記に示す基準で指数を与え、下記の式によって処理区の発病度を求め、防除率を算出した。また、薬液を散布せずに、上記と同様にコムギ赤さび病菌の夏胞子懸濁液を接種し発病させた無処理区の発病度から同様に防除率を算出した。

指数 0 : 病斑なし

1 : 数個の病斑

2 : 発病面積が葉面積の1/4未満

3 : 発病面積が葉面積の1/4以上1/2未満

4 : 発病面積が葉面積の1/2以上3/4未満

5 : 発病面積が葉面積の3/4以上

$$\text{発病度} = \Sigma (\text{指数} \times \text{該当株数}) / (\text{調査株数} \times 5) \times 100$$

$$\text{防除率} = (1 - \text{処理区の発病度} / \text{無処理区の発病度}) \times 100$$

その結果は、下記第3表に示されるとおりである。また、薬害は認められなか

った。

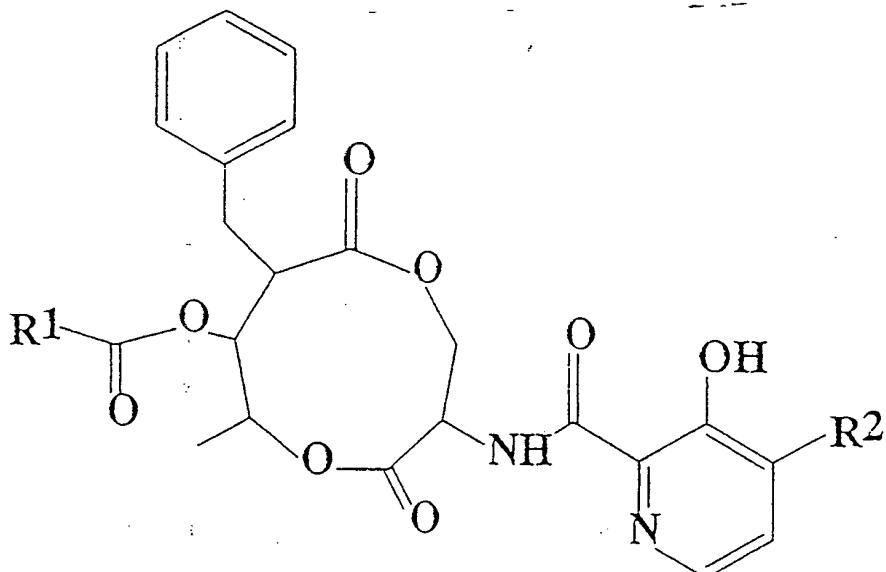
第3表

コムギ赤さび病防除効果試験結果

試料名	濃度(ppm)	防除価
無処理	—	0
UK-2A	10	100
UK-2B	10	100
UK-2C	10	100
UK-2D	10	100
UK-3A	10	100
バイレトン水和剤	10	60

## 請求の範囲

1. 下記の式（I）で表される化合物を含んでなる、イネいもち病防除剤：



BEST AVAILABLE COPY

[式中、

$R^1$ は直鎖若しくは分岐鎖状である飽和脂肪族炭化水素基、または直鎖若しくは分岐鎖状である不飽和脂肪族炭化水素基を表し、

$R^2$ は水素原子またはメトキシ基を表す]

2.  $R^1$ が、イソプロピル基、(Z)-2-ブテニル基、イソブチル基、またはsec-ブチル基であり、 $R^2$ が水素原子またはメトキシ基である化合物を含んでなる、請求項1に記載のイネいもち病防除剤。

3. 請求項1で定義された式（I）の化合物を、イネの植物体自体、その種子、それが生育しているまたは生育を予定された圃場、またはその生育に利用される器具に施用する工程を含んでなる、イネいもち病の防除法。

4. 式（I）の化合物をイネ茎葉へ散布し、または式（I）の化合物による

イネ経根処理、田面処理、水面処理、側条処理、土壤処理、イネ種子処理、または苗箱処理に付す工程を含んでなる、請求項3に記載の方法。

5. 請求項1で定義された式(I)の化合物を含んでなる、コムギ赤さび病防除剤。

6.  $R^1$ が、イソプロピル基、(Z)-2-ブテニル基、イソブチル基、またはsec-ブチル基であり、 $R^2$ が水素原子またはメトキシ基である化合物を含んでなる、請求項5に記載のコムギ赤さび病防除剤。

7. 請求項1で定義された式(I)の化合物を、コムギの植物体自体、その種子、それが生育しているまたは生育を予定された圃場、またはその生育に利用される器具に施用する工程を含んでなる、コムギ赤さび病の予防または防除法。

8. 式(I)の化合物をコムギ茎葉へ散布し、または式(I)の化合物によるコムギ経根処理、畑面処理、側条処理、土壤処理、コムギ種子処理、または苗箱処理に付す工程を含んでなる、請求項7に記載の方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/03876

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
Int.Cl<sup>6</sup> A01N43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>6</sup> A01N43/40

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 7-233165, A (Suntory Ltd.), 5 September, 1995 (05. 09. 95), Claims 1, 2 ; page 5, left column, lines 36 to 44 (Family: none)	1-8
X	UEKI et al., "UK-3A, a novel antifungal antibiotic from Streptomyces sp.517-02: fermentation, isolation, structural elucidation and biological properties". Journal of Antibiotics, 1997, Vol. 50(7), p.551-555.	1-8
X	HANAFI et al., "UK-2A, B, C and D, novel antifungal antibiotics from Streptomyces sp.517-02. II. Structural elucidation". Journal of Antibiotics, 1996, Vol. 49(12), p.1226-1231.	1-8

## BEST AVAILABLE COPY

 Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier document but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
12 November, 1998 (12. 11. 98)Date of mailing of the international search report  
24 November, 1998 (24. 11. 98)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## 国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/03876

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl<sup>1</sup> A01N43/40

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl<sup>1</sup> A01N43/40

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

## 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN)

REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	J P, 7-233165, A (サントリー株式会社), 5. 9月. 1995 (05.09.95), 特許請求の範囲1及び2, 第5 頁, 左欄, 第36-44行 (ファミリーなし)	1-8
X	UEKI et al. "UK-3A, a novel anti fungal antibiotic from Strepto myces sp. 517-02: fermentation, isolation, structural elucidatio n and biological properties." J ournal of Antibiotics, 1997, Vo l. 50 (7), p. 551-555.	1-8

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

## の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」同一パテントファミリー文献

## 国際調査を完了した日

12. 11. 98

## 国際調査報告の発送日

24.11.98

## 国際調査機関の名称及び先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

## 特許庁審査官(権限のある職員)

関 千弥子

4H 9837

C(続き) 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	HANAFI et al. "UK-2A, B, C and D, novel antifungal antibiotics from <i>Streptomyces</i> sp. 517-02. I. Structural elucidation." Journal of Antibiotics, 1996, Vol. 49 (12), p. 1226-1231.	1-8